



УКРАЇНА

(19) UA

(11) 118257

(13) C2

(51) МПК

A01N 43/653 (2006.01)

A01N 25/32 (2006.01)

МІНІСТЕРСТВО
ЕКОНОМІЧНОГО
РОЗВИТКУ І ТОРГІВЛІ
УКРАЇНИ

(12) ОПИС ДО ПАТЕНТУ НА ВИНАХІД

(21) Номер заявки:	а 2015 08522	(56) Перелік документів, взятих до уваги експертизою: "241 DIFENOCONAZOLE", PESTICIDE MANUAL, XX, XX, 01.01.2000, vol. 12, page 290 WO 2007/031309 A2 (SYNGENTA PARTICIPATIONS AG [CH], GODWIN JEREMY [CH]; GUICHERIT ERIC [CH]), 22.03.2007 WO 2007/065843 A2 (BASF AG [DE], VOESTE DIRK [DE]; STRATHMANN SIEGFRIED [DE]; DOMBO PETER), 14.06.2007 US 2010/184816 A1 (HAUSER-HAHN ISOLDE [DE]), 22.07.2010 FENGSHOU DONG ET AL., "Chiral Triazole Fungicide Difenconazole: Absolute Stereochemistry, Stereoselective Bioactivity, Aquatic Toxicity, and Environmental Behavior in Vegetables and Soil", ENVIRONMENTAL SCIENCE & TECHNOLOGY, 01.03.2013 ZHOU YING ET AL., "Enantiomer separation of triazole fungicides by high-performance liquid chromatography", CHIRALITY, 01.04.2009, vol. 21, no. 4, pages 421-427 JING LI ET AL., "Simultaneous enantioselective determination of triazole fungicide difenoconazole and its main chiral metabolite in vegetables and soil by normal-phase high-performance liquid chromatography", ANALYTICAL AND BIOANALYTICAL CHEMISTRY, 11.08.2012, vol. 404, no. 6-7, pages 2017-2031 NITHYAMEENAKSHI S. ET AL., "Investigations on Phytotoxicity of Two New Fungicides, Azoxystrobin and Difenconazole", AMERICAN JOURNAL OF PLANT PHYSIOLOGY, 01.01.2006, vol. 1, no. 1, pages 89-98 US 5266585 A (HUBELE ADOLF [CH] et al.), 30.11.1993
(22) Дата подання заявки:	27.01.2014	
(24) Дата, з якої є чинними права на винахід:	26.12.2018	
(31) Номер попередньої заявки відповідно до Паризької конвенції:	1301979.9	
(32) Дата подання попередньої заявки відповідно до Паризької конвенції:	04.02.2013	
(33) Код держави-учасниці Паризької конвенції, до якої подано попередню заявку:	GB	
(41) Публікація відомостей про заявку:	12.10.2015, Бюл.№ 19	
(46) Публікація відомостей про видачу патенту:	26.12.2018, Бюл.№ 24	
(86) Номер та дата подання міжнародної заявки, поданої відповідно до Договору РСТ	PCT/EP2014/051528, 27.01.2014	
(72) Винахідник(и): Годвін Джеремі Роберт (CH), Хемінг Александер Марк (CH), Лотшюц Крістіан (CH), Шнайтер Петер (CH), Штуц Вольфганг (CH)		
(73) Власник(и): СІНГЕНТА ПАРТІСІПЕЙШНС АГ, Schwarzwaldallee 215, CH-4058 Basel, Switzerland (CH)		
(74) Представник: Петров Андрій Володимирович, реєстр. №139		

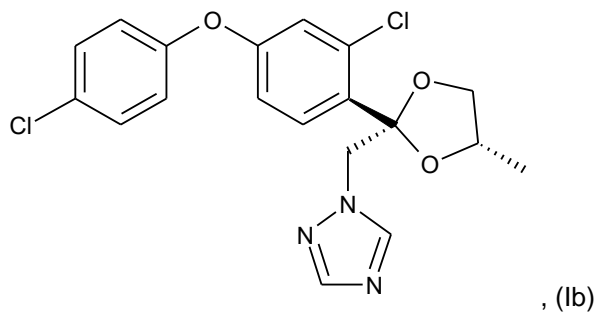
(54) СТЕРЕІЗОМЕРНА КОМПОЗИЦІЯ ДИФЕНОКОНАЗОЛУ ЗІ ЗНИЖЕНОЮ ФІТОТОКСИЧНІСТЮ

(57) Реферат:

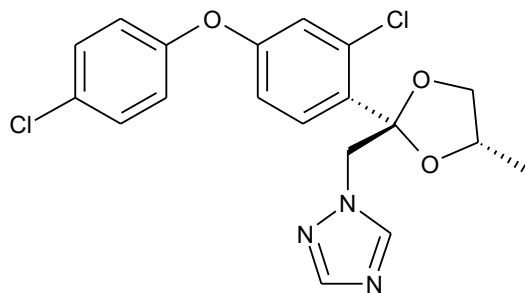
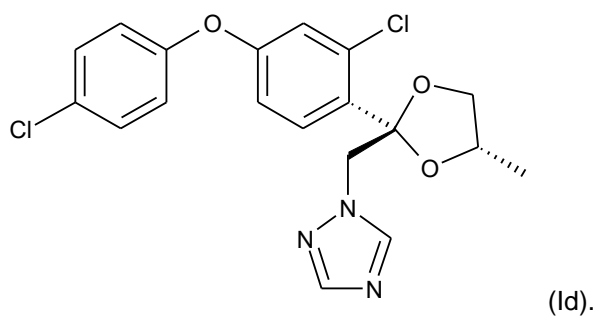
Даний винахід стосується композиції та її застосування в способі захисту рослини або матеріалу для розмноження рослини від фітотоксичного ефекту дифеноконазолу. Більш конкретно, композиція, яка містить дифеноконазол, відрізняється тим, що щонайменше 40 % за

UA 118257 C2

вагою зазначеного дифенокназолу являє собою 2R,4S-ізомер, зображений у вигляді формули (Ib):



та де щонайменше 95 % за вагою решти дифенокназолу являє собою 2S,4S-ізомер, зображений у вигляді формули (Id):



Даний винахід відноситься до фунгіцидної композиції, яка містить дифеноконазол у фунгіцидно ефективній кількості, внаслідок чого при застосуванні вказаної композиції щодо рослини або матеріалу для розмноження зазначена композиція характеризується зниженим фітотоксичним ефектом відносно зазначеної рослини або матеріалу для розмноження.

Відомо, що деякі засоби захисту рослин, такі як фунгіциди, можуть мати фітотоксичний ефект щодо культурних рослин. Наприклад, у F. Montfort et al., Pesticide Science 46(4), 1996, 315-322, повідомляють, що застосування азолових фунгіцидів, таких як тритиконазол, для обробки насіння і культурних рослин може несприятливо впливати на ріст рослин. У WO2008/155416 описано використання гібереліну для зниження або попередження фітотоксичного ефекту азолових фунгіцидів або азолових фунгіцидів, використовуваних у комбінації з анілідними фунгіцидами, головним чином, для обробки насіння. В WO2007/065843 описано використання гібереліну як антидоту для азолових фунгіцидів, зокрема, з метою обернення ефектів уповільнення росту та затримки проростання або перешкоджання йому. В цих рішеннях попереднього рівня техніки застосовують додавання речовини до композиції, яка містить азоловий фунгіцид.

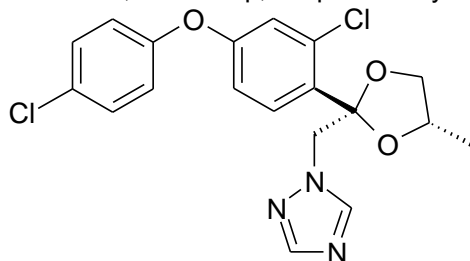
У Zawisza et al. Progress in Plant Protection, Vol. 44(2), 2004, описано розділення цис- і транс-ізомерів за допомогою тонкошарової хроматографії та подальше тестування цис- і транс-ізомерів тільки за фунгіцидною ефективністю.

Конкретним типом фітотоксичного ефекту, який може обмежувати практичну значимість деяких фунгіцидів, є хлороз і зневоднення листя, що проявляється у вигляді пожовтіння та/або побуріння листя рослини щодо якої застосовують фунгіцид, що в деяких випадках може виникати при застосуванні оптимальних рівнів фунгіциду для боротьби з грибами. Зниження норми внесення фунгіциду, як правило, буде знижувати ефект пожовтіння та/або побуріння листя, але при цьому фунгіцид не буде присутній в оптимальній нормі для контролю грибів. Існує необхідність у способах попередження або щонайменше ослаблення фітотоксичних ефектів, таких як ефект пожовтіння та/або побуріння листя, обумовлений фунгіцидами, для максимального збільшення потенціалу їх фунгіцидної ефективності. Даний винахід орієнтований на задоволення цих потреб.

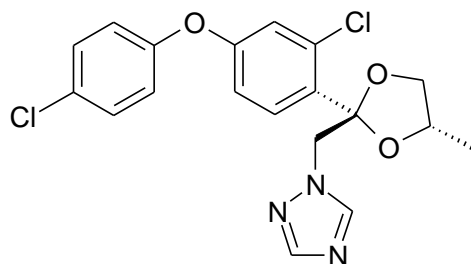
Зберігається необхідність у пошуку способів захисту рослин від фітопатогенних організмів, при обмеженні в той же час впливу цих способів на навколишнє середовище. Із зростанням населення в світі як і раніше існує необхідність у створенні ще більш ефективних способів максимального збільшення виходу продукції від все більш цінних і дорогих земель сільськогосподарського призначення у світі.

Нещодавно несподівано було встановлено, що збільшення кількості 2R, 4S ізомерів дифеноконазолу в композиції може знижувати/попереджати фітотоксичний ефект дифеноконазолу, зберігаючи при цьому фунгіцидний ефект. Отже, збільшення % за вагою 2R, 4S ізомерів надає дифеноконазолу ефект "уберігання", який дає можливість його застосування щодо рослин, які забезпечують відмінний контроль фітопатогенних грибів, не будучи при цьому несприятливим для життєздатності або зовнішнього вигляду рослин. Більш того, у багатьох випадках композиції, згідно даному винаходу, забезпечують гарний контроль фітопатогенних грибів і також покращують життєздатність або зовнішній вигляд рослини.

Відповідно до даного винаходу пропонується фунгіцидна композиція, що містить дифеноконазол, яка відрізняється тим, що щонайменше 40 % за вагою вказаного дифеноконазолу являє собою 2R, 4S ізомер, зображений у вигляді формули (Ib):



і де щонайменше 95 % за вагою решти дифеноконазолу являють собою 2S, 4S ізомер, зображений у вигляді формули (Id):



(Id)

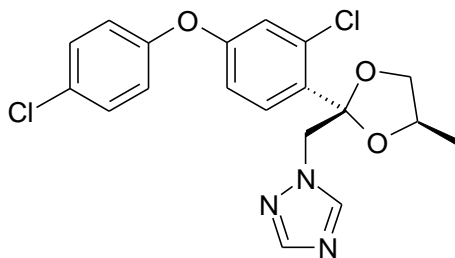
Крім того, переважно є описана вище фунгіцидна композиція, де вся зазначена решта дифеноконазолу являє собою 2S, 4S ізомер, зображений у вигляді формули (Id).

У наступному варіанті здійснення даного винаходу фунгіцидна композиція містить щонайменше 55 %, або щонайменше 60 %, або щонайменше 65 %, або щонайменше 80 % за вагою зазначеного дифеноконазолу, що являє собою R, 4S ізомер, зображений у вигляді формули (Ib), та переважно вся зазначена решта дифеноконазолу являє собою зазначений 2S, 4S ізомер, зображений у вигляді формули (Id).

Дифеноконазол (1-[2-[2-хлор-4-(4-хлорфенокси)феніл]-4-метил-1,3-діоксолан-2-ілметил]-1H-1,2,4-триазол) являє собою фунгіцид, який є ефективним щодо ряду захворювань, викликаних аскоміцетами, базидіоміцетами та дейтероміцетами. Дифеноконазол описаний у "The Pesticide Manual" [The Pesticide Manual-A World Compendium; Fourteenth Edition; Editor: C. D. S. Tomlin; The British Crop Protection Council] під реєстраційним номером 253.

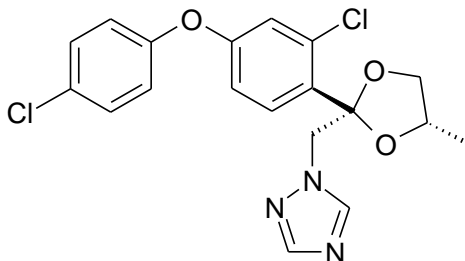
Ізомери дифеноконазолу, відомі фахівцям у даній галузі, наведені нижче:

2S, 4R (цис-):



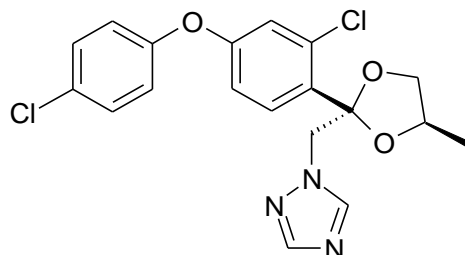
(Ia)

15 2R, 4S (цис-):



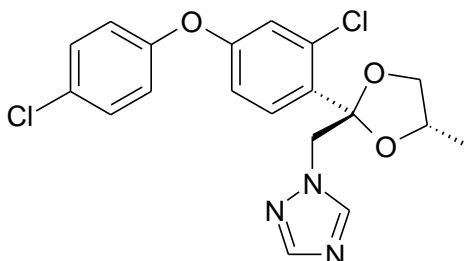
(Ib)

2R, 4R (транс-):



(Ic)

2S, 4S (транс-):



(Id)

Протягом отримання дифеноконазол, як правило, виробляють у співвідношенні цис:транс приблизно 60:40, із співвідношенням цис- і транс-рацематів 1:1, тобто

60:40 2S, 4R (Ia) і 2R, 4S (Ib): 2R, 4R (Ic) і 2S, 4S (Id); і

1:1 2S, 4R (Ia): 2R, 4S (Ib) і 1:1 2R, 4R (Ic): 2S, 4S (Id). При типовому виробництві отриманий дифеноконазол містить приблизно 30 % (Ia), приблизно 30 % (Ib), приблизно 20 % (Ic) та приблизно 20 % (Id). Прикладом цього є продукт Score 250EC™.

Автори несподівано встановили, що шляхом збільшення кількості ізомеру (Ib) в суміші ізомерів дифеноконазолу отриманий продукт залишається фунгіцидним, але також проявляє

знижені фітотоксичні ефекти при застосуванні щодо рослин або матеріалів для розмноження. "Знижений фітотоксичний ефект" можна оцінювати шляхом порівняння з контрольною рослиною/матеріалом для розмноження, які обробляли такою ж кількістю дифеноконазолу, але де 2R, 4S ізомер, зображений у вигляді формули (Ib), присутній в меншій кількості, ніж %, присутній у композиції відповідно до даного винаходу. Фахівцеві у даній галузі добре відомо як належним чином проводити контрольовані експерименти, та, таким чином, він може провести порівняльну оцінку шляхом вирощування двох груп рослин одного виду/сорту в однакових умовах, де одну із зазначених груп (що являє собою рослину або матеріал для розмноження рослини) піддають обробці композицією, яка містить дифеноконазол з 2R, 4S ізомером у % за вагою відповідно до даного винаходу, як, наприклад, 51 % або вище, при цьому контрольну групу обробляють композицією, яка містить дифеноконазол з 2R, 4S ізомером у % за вагою не відповідно до даного винаходу, як, наприклад, 30 %, що дозволяє, таким чином, зазначеному фахівцеві у даній галузі встановити зменшення/попередження фітотоксичного ефекту. Те ж саме відноситься до оцінки порівняння з використанням будь-якої іншої композиції відповідно до даного винаходу. У цьому випадку порівняння буде включати використання композиції, яка має характеристики відповідно до даного винаходу, з подібною композицією, яка містить таку ж кількість дифеноконазолу, але де 2R, 4S ізомер, який зображений у вигляді формули (Ib), присутній в меншій кількості, ніж % будь якої композиції відповідно до даного винаходу. Наприклад, порівняння може бути проведено між дифеноконазолом згідно з попереднім рівнем техніки, який містить 30 % (Ia), 30 % (Id), 20 % (Ic) і 20 % (Id), та дифеноконазолом відповідно до даного винаходу, який містить приблизно тільки 60 % (Ib) та 40 % (Id), при цьому тест проводять на подібних рослинах у таких же умовах і при цьому дифеноконазол застосовують у тій же нормі, тільки % ізомерів між двома зразками відрізняється.

Якщо композицію відповідно до даного винаходу застосовують щодо матеріалу для розмноження рослини, знижений фітотоксичний ефект можна спостерігати на матеріалі для розмноження та/або рослині, що отримана з нього. Наприклад, якщо композицію відповідно до даного винаходу застосовують щодо насіння, то рослина, особливо ранній проросток, отриманий в результаті проростання насіння, є доказом зниженого фітотоксичного ефекту композиції відповідно до даного винаходу.

Фахівець у даній галузі зрозуміє, що в композиціях відповідно до даного винаходу цілком імовірна присутність дуже малої кількості "домішок" інших присутніх ізомерів, наприклад, домішок небажаних ізомерів дифеноконазолу до приблизно 0,5 % за вагою дифеноконазолу. Таким чином, фахівець у даній галузі зрозуміє, що композиція відповідно до даного винаходу, яка зазначена такою, що містить приблизно 80 % 2R, 4S ізомеру, зображеного у вигляді формули (Ib), і 20 % 2S, 4S ізомеру, зображеного у вигляді формули (Id), за вагою дифеноконазолу може містити приблизно 0,5 % 2S, 4R ізомеру, зображеного у вигляді формули (Ia), та/або 2R, 4R ізомеру, зображеного у вигляді формули (Ic).

Крім того, фахівець у даній галузі зрозуміє, що отримання композицій відповідно до даного винаходу, які містять збагачені ізомери відповідно до даного опису, в таких виробничих процесах може бути надзвичайно дорогим. Хоча це може бути переважним для отримання композиції, яка містить переважно або виключно 2R, 4S ізомер, зображений у вигляді формули (Ib), також переважним може бути створення композиції, яка крім того містить 2R, 4S ізомер, зображений у вигляді формули (Ib), в кількості, яка надає знижений фітотоксичний ефект відповідно до даного винаходу за допомогою способу з найбільш оптимальними витратами. Беручи це до уваги, в конкретному аспекті даного винаходу пропонується композиція, що містить приблизно 60 % за вагою 2R, 4S ізомеру, зображеного у вигляді формули (Ib), та приблизно 40 % за вагою 2S, 4S ізомеру, зображеного у вигляді формули (Id).

У ще одному аспекті за даним винаходом пропонується фунгіцидна композиція, що містить дифеноконазол, яка відрізняється тим, що щонайменше 40 % за вагою зазначеного дифеноконазолу являє собою 2R, 4S ізомер, зображений у вигляді формули (Ib), та де

щонайменше 50 % за вагою решти дифеноконазолу являє собою 2S, 4S ізомер, зображений у вигляді формули (Id) вище.

Прикладом такої композиції є композиція, яка містить приблизно 40 % 2R, 4S ізомеру дифеноконазолу, зображеного у вигляді формули (Ib), та 50 % за вагою решти дифеноконазолу, який являє собою 2S, 4S ізомер, зображений у вигляді формули (Id), при цьому 30 % 2S, 4R ізомеру також присутні у композиції, а решта 30 %, являють собою 2S, 4R ізомер формули (Ia) та/або the 2R, 4R ізомер формули (Ic).

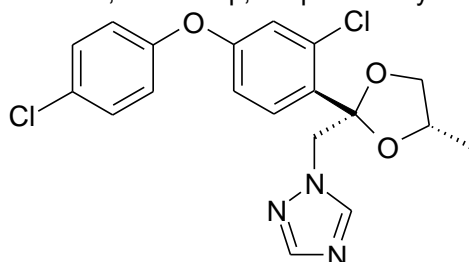
Даний винахід додатково пропонує визначену вище композицію, яка відрізняється тим, що щонайменше % за вагою зазначеного дифеноконазолу являє собою 2R, 4S ізомер, зображений у вигляді формули (Ib), де зазначений % вибраний у порядку зростання переваги з наступного: 41 %, 42 %, 43 %, 44 %, 45 %, 46 %, 47 %, 48 %, 49 %, 50 %, 51 %, 52 %, 53 %, 54 %, 55 %, 56 %, 57 %, 58 %, 59 %, 60 %, 61 %, 62 %, 63 %, 64 %, 65 %, 66 %, 67 %, 68 %, 69 %, 70 %, 71 %, 72 %, 73 %, 74 %, 75 %, 76 %, 77 %, 78 %, 79 %, 80 %, 81 %, 82 %, 83 %, 84 %, 85 %, 86 %, 87 %, 88 %, 89 %, 90 %, 91 %, 92 %, 93 %, 94 %, 95 %, 96 %, 97 %, 98 %, 99 % і 99 %, та щонайменше 50 % за вагою решти дифеноконазолу являє собою 2S, 4S ізомер, зображений у вигляді формули (Id), більш переважно щонайменше 90 % за вагою решти дифеноконазолу являє собою 2S, 4S ізомер, зображений у вигляді формули (Id), більш переважно щонайменше 95 % за вагою решти дифеноконазолу являє собою 2S, 4S ізомер, зображений у вигляді формули (Id), більш переважно вся решта дифеноконазолу за вагою являє собою 2S, 4S ізомер, зображений у вигляді формули (Id).

Даний винахід додатково пропонує фунгіцидну композицію, яка описана вище, де в порядку зростання переваги щонайменше 51 %, 52 %, 53 %, 54 %, 55 %, 56 %, 57 %, 58 %, 59 %, 60 %, 61 %, 62 %, 63 %, 64 %, 65 %, 66 %, 67 %, 68 %, 69 %, 70 %, 71 %, 72 %, 73 %, 74 %, 75 %, 76 %, 77 %, 78 %, 79 %, 80 %, 81 %, 82 %, 83 %, 84 %, 85 %, 86 %, 87 %, 88 %, 89 %, 90 %, 91 %, 92 %, 93 %, 94 %, 95 %, 96 %, 97 %, 98 % 99 % і 100 % за вагою решти дифеноконазолу являє собою 2S, 4S ізомер, зображений у вигляді формули (Id). Таким чином, в одному варіанті здійснення композиція містить 99 % за вагою 2R, 4S ізомеру, зображеного у вигляді формули (Ib), та 1 % за вагою 2S, 4S ізомеру, зображеного у вигляді формули (Id). Аналогічним чином, у додатковому варіанті здійснення композиція містить 98 % за вагою 2R, 4S ізомеру, зображеного у вигляді формули (Ib), та 2 % за вагою 2S, 4S ізомеру, зображеного у вигляді формули (Id). Як згадувалося вище, у переважному варіанті здійснення за даним винаходом композиція містить приблизно 60 % за вагою 2R, 4S ізомеру, зображеного у вигляді формули (Ib), та приблизно 40 % за вагою 2S, 4S ізомеру, зображеного у вигляді формули (Id).

Також розкриті наступні комбінації 2R, 4S ізомеру у % за вагою, зображеного у вигляді формули (Ib), та 2S, 4S ізомеру у % за вагою, зображеного у вигляді формули (Id):

97 % (Ib) і 3 % (Id), 96 % (Ib) і 4 % (Id), 95 % (Ib) і 5 % (Id), 94 % (Ib) і 6 % (Id), 93 % (Ib) і 7 % (Id), 92 % (Ib) і 8 % (Id), 91 % (Ib) і 9 % (Id), 90 % (Ib) і 10 % (Id), 89 % (Ib) і 11 % (Id), 88 % (Ib) і 12 % (Id), 87 % (Ib) і 13 % (Id), 86 % (Ib) і 14 % (Id), 85 % (Ib) і 15 % (Id), 84 % (Ib) і 16 % (Id), 83 % (Ib) і 17 % (Id), 82 % (Ib) і 18 % (Id), 81 % (Ib) і 19 % (Id), 80 % (Ib) і 20 % (Id), 79 % (Ib) і 21 % (Id), 78 % (Ib) і 22 % (Id), 77 % (Ib) і 23 % (Id), 76 % (Ib) і 24 % (Id), 75 % (Ib) і 25 % (Id), 74 % (Ib) і 26 % (Id), 73 % (Ib) і 27 % (Id), 72 % (Ib) і 28 % (Id), 71 % (Ib) і 29 % (Id), 70 % (Ib) і 30 % (Id), 69 % (Ib) і 31 % (Id), 68 % (Ib) і 32 % (Id), 67 % (Ib) і 33 % (Id), 66 % (Ib) і 34 % (Id), 65 % (Ib) і 35 % (Id), 64 % (Ib) і 36 % (Id), 63 % (Ib) і 37 % (Id), 62 % (Ib) і 38 % (Id), 61 % (Ib) і 39 % (Id), 60 % (Ib) і 40 % (Id), 59 % (Ib) і 41 % (Id), 58 % (Ib) і 42 % (Id), 57 % (Ib) і 43 % (Id), 56 % (Ib) і 44 % (Id), 55 % (Ib) і 45 % (Id), 54 % (Ib) і 46 % (Id), 53 % (Ib) і 47 % (Id), 52 % (Ib) і 48 % (Id), 51 % (Ib) і 49 % (Id), 50 % (Ib) і 50 % (Id), 49 % (Ib) і 51 % (Id), 48 % (Ib) і 52 % (Id), 47 % (Ib) і 53 % (Id), 46 % (Ib) і 54 % (Id), 45 % (Ib) і 55 % (Id), 44 % (Ib) і 56 % (Id), 43 % (Ib) і 57 % (Id), 42 % (Ib) і 58 % (Id), 41 % (Ib) і 59 % (Id), і 40 % (Ib), і 60 % (Id).

У ще одному аспекті даного винаходу також пропонується фунгіцидна композиція, що містить дифеноконазол, яка відрізняється тим, що щонайменше 51 % за вагою зазначеного дифеноконазолу являє собою 2R, 4S ізомер, зображений у вигляді формули (Ib):



(Ib)

У додатковому варіанті здійснення за даним винаходом зазначена композиція відрізняється тим, що щонайменше % за вагою зазначеного дифенокназолу являє собою 2R, 4S ізомер, зображений у вигляді формули (Ib), де зазначений % вибраний у порядку зростання переваги з: 52 %, 53 %, 54 %, 55 %, 56 %, 57 %, 58 %, 59 %, 60 %, 61 %, 62 %, 63 %, 64 %, 65 %, 66 %, 67 %, 68 %, 69 %, 70 %, 71 %, 72 %, 73 %, 74 %, 75 %, 76 %, 77 %, 78 %, 79 %, 80 %, 81 %, 82 %, 83 %, 84 %, 85 %, 86 %, 87 %, 88 %, 89 %, 90 %, 91 %, 92 %, 93 %, 94 %, 95 %, 96 %, 97 %, 98 % і 99 %. У конкретному варіанті здійснення винаходу за даним винаходом зазначена композиція містить 100 % 2R, 4S ізомеру, зображеного у вигляді формули (Ib).

У додатковому аспекті за даним винаходом пропонується фунгіцидна композиція, що містить дифенокназол, яка відрізняється тим, що щонайменше 40 % за вагою зазначеного дифенокназолу являє собою 2R, 4S ізомер, зображений у вигляді формули (Ib), та де щонайменше 1 % за вагою решти дифенокназолу являє собою 2S, 4S ізомер, зображений у вигляді формули (Id), або 2R, 4R ізомер, зображений у вигляді формули (Ic) вище. У конкретному варіанті здійснення за даним винаходом зазначена композиція відрізняється тим, що щонайменше % за вагою зазначеного дифенокназолу являє собою 2R, 4S ізомер, зображений у вигляді формули (Ib), де зазначений % вибраний з 45 % - 85 %. У додатковому варіанті здійснення за даним винаходом зазначена композиція відрізняється тим, що щонайменше % за вагою зазначеного дифенокназолу являє собою 2R, 4S ізомер, зображений у вигляді формули (Ib), де зазначений % вибраний з 50 % - 80 %. У ще одному варіанті здійснення за даним винаходом зазначена композиція відрізняється тим, що щонайменше % за вагою зазначеного дифенокназолу являє собою 2R, 4S ізомер, зображений у вигляді формули (Ib), де зазначений % вибраний з 55 % - 75 %. У ще одному варіанті здійснення винаходу за даним винаходом зазначена композиція відрізняється тим, що щонайменше % за вагою зазначеного дифенокназолу являє собою 2R, 4S ізомер, зображений у вигляді формули (Ib), де зазначений % вибраний з 60 % - 70 %. Усі композиції, що описані у даному абзаці, містять щонайменше 1 % за вагою 2S, 4S ізомеру, зображеного у вигляді формули (Id), або 2R, 4R ізомеру, зображеного у вигляді формули (Ic) вище. У додатковому варіанті здійснення винаходу за даним винаходом композиції, описані в даному абзаці, містять щонайменше 5 % за вагою 2S, 4S ізомеру, зображеного у вигляді формули (Id), або 2R, 4R ізомеру, зображеного у вигляді формули (Ic) вище.

Даний винахід додатково пропонує фунгіцидну композицію, описану вище, яка додатково містить один або декілька компонентів, вибраних з груп, що складаються з допоміжного засобу, носія та поверхнево-активної речовини.

Допоміжні засоби для складання, які є придатними для отримання композицій винаходу за даним винаходом, відомі per se. Як рідкі носії можуть бути використані наступні: вода, толуол, ксилол, петролейний етер, рослинні олії, ацетон, метилетилкетон, циклогексанон, ангідриди кислот, ацетонітрил, ацетофенон, амілацетат, 2-бутанон, бутиленкарбонат, хлорбензол, циклогексан, циклогексанол, алкілові естери оцтової кислоти, діацетоновий спирт, 1,2-дихлорпропан, діетаноламін, n-діетилбензол, діетиленгліколь, діетиленгліколю абітат, бутиловий етер діетиленгліколю, етиловий етер діетиленгліколю, метиловий етер діетиленгліколю, N, N-диметилформамід, диметилсульфоксид, 1,4-діоксан, дипропіленгліколь, метиловий етер дипропіленгліколю, дибензоат дипропіленгліколю, дипроксітол, алкілпіролідон, етилацетат, 2-етилгексанол, етиленкарбонат, 1,1,1-трихлоретан, 2-гептанон, альфа-пінен, d-лімонен, етиллактат, етиленгліколь, бутиловий етер етиленгліколю, метиловий етер етиленгліколю, гамма-бутиролактон, гліцерин, ацетат гліцерину, діацетат гліцерину, триацетат гліцерину, гексадекан, гексиленгліколь, ізоамілацетат, ізобронілацетат, ізооктан, ізофорон, ізопропілбензол, ізопропілміристат, молочна кислота, лауриламін, мезитилоксид, метоксіпропанол, метаізоамілкетон, метізобутилкетон, метиллаурат, метилоктаноат, метилолеат, метиленхлорид, мета-ксилол, n-гексан, n-октиламін, октадеканова кислота, октиламінацетат, олеїнова кислота, олеїламін, орто-ксилол, фенол, поліетиленгліколь, пропіонова кислота, пропіллактат, пропіленкарбонат, пропіленгліколь, метиловий етер пропіленгліколю, пара-ксилол, толуол, триетилфосфат, триетиленгліколь, ксилолсульфонова кислота, парафін, мінеральне масло, трихлоретилен, перхлоретилен, етилацетат, амілацетат, бутилацетат, метиловий етер пропіленгліколю, метиловий етер діетиленгліколю, метанол, етанол, ізопропанол та високомолекулярні спирти, такі як аміловий спирт, тетрагідрофурфуриловий спирт, гексанол, октанол, етиленгліколь, пропіленгліколь, гліцерин, N-метил-2-піролідон тощо.

Придатними твердими носіями є, наприклад, тальк, діоксид титану, пірофілітова глина, діоксид кремнію, атапульгітова глина, кізельгур, вапняк, карбонат кальцію, бентоніт, кальцієвий

монтморилоніт, лушпиння насіння бавовнику, пшеничне борошно, соєве борошно, пемза, деревне борошно, подрібнена шкаралупа волоських горіхів, лігнін і подібні речовини.

Велику кількість поверхнево-активних речовин можна успішно використовувати як у твердих, так і у рідких складах, зокрема, в таких складах, які можна розбавити носієм перед застосуванням. Поверхнево-активні речовини можуть бути аніоногенними, катіоногенними, неіоногенними або полімерними, та їх можна використовувати як емульгатори, змочувальні засоби або суспендувальні засоби або для іншої мети. Стандартні поверхнево-активні речовини включають, наприклад, солі алкілсульфатів, такі як діетаноламонію лаурилсульфат; солі алкіларилсульфонатів, такі як додецилбензолсульфонат кальцію; продукти приєднання алкілфенолу/алкіленоксиду, такі як нонілфенолу етилоксилат; продукти приєднання спирту/алкіленоксиду, такі як етоксилат тридецилового спирту; мила, такі як стеарат натрію; солі алкілнафталінсульфонатів, такі як натрію дибутілнафталінсульфонат; діалкілові естери сульфосукцинатних солей, такі як натрію ді(2-етилгексил)сульфосукцинат; естери сорбіту, такі як сорбітололеат; четвертинні аміни, такі як лаурилтриметиламонію хлорид, поліетилєнглїкольові естери жирних кислот, такі як стеарат поліетилєнглїколю; блок-співполімери етиленоксиду та пропіленоксиду та солі моно- та діалкілфосфатних естерів; а також додаткові речовини, що описані, наприклад, у McCutcheon's Detergents and Emulsifiers Annual, MC Publishing Corp., Ridgewood New Jersey (1981).

Додаткові допоміжні засоби, які можна використовувати в пестицидних складах, включають інгібітори кристалізації, модифікатори в'язкості, суспендувальні засоби, барвники, антиоксиданти, спінювачі, поглиначі світла, допоміжні засоби для змішування, піногасники, комплексоутворювальні засоби, нейтралізувальні та рН-модифікуючі речовини та буфери, інгібітори корозії, запашники, змочувальні засоби, підсилювачі поглинання, поживні мікроелементи, пластифікатори, ковзні речовини, змашувальні засоби, диспергувальні засоби, загусники, антифризи, мікробіоциди й рідкі та тверді добрива.

Композиції за даним винаходом можуть включати добавку, що містить рослинні або тваринні масла, мінеральне масло, алкілові естери таких масел або суміші таких масел і похідних масел. Кількість масляної добавки у композиції за даним винаходом зазвичай становить від 0,01 до 10 % з урахуванням суміші для застосування. Наприклад, масляну добавку можна вносити в резервуар обприскувача в необхідній концентрації після підготовки суміші для обприскування. Переважні масляні добавки включають мінеральні масла або рослинні масла, наприклад ріпакову олію, оливкову олію або соняшникову олію, емульговану рослинну олію, алкілові естери рослинних масел, наприклад, метилові похідні, або тваринне масло, таке як риб'ячий жир або яловиче сало. Переважні масляні добавки містять алкілові естери C8-C22 жирних кислот, особливо метилові похідні C12-C18 жирних кислот, наприклад, метилові естери лаурилової кислоти, пальмітинової кислоти та олеїнової кислоти (метиллаурат, метилпальмітат і метилолеат, відповідно). Багато похідних масел відомі з the Compendium of Herbicide Adjuvants, 10th Edition, Southern Illinois University, 2010.

Ще в одному аспекті за даним винаходом пропонується рослина або матеріал для розмноження, які обробляли композицією відповідно до даного винаходу.

Ще в одному аспекті за даним винаходом пропонується оброблена рослина або оброблений матеріал для розмноження, які є результатом подальшої обробки композицією винаходу відповідно до даного винаходу. Отже, винахід поширюється на рослину або матеріал для розмноження, які містять композицію відповідно до даного винаходу.

Ще в одному аспекті за даним винаходом пропонується спосіб контролю грибів на рослині або матеріалі для розмноження, що передбачає застосування щодо зазначеної рослини або матеріалу для розмноження фунгіцидно ефективної кількості композиції відповідно до даного винаходу.

Ще в одному аспекті за даним винаходом пропонується спосіб контролю грибів на рослині або матеріалі для розмноження за допомогою композиції, яка характеризується зниженим фітотоксичним ефектом щодо зазначеної рослини або матеріалу для розмноження, при цьому зазначений спосіб передбачає застосування щодо зазначеної рослини або матеріалу для розмноження фунгіцидно ефективної кількості композиції відповідно до даного винаходу.

Ще в одному аспекті винаходу за даним винаходом пропонується спосіб, описаний вище, де зазначену композицію за даним винаходом, що містить дифеноконазол, застосовують щодо місця, де матеріал для розмноження рослини висіано/внесено та/або де вирощується рослина.

Даний винахід додатково пропонує спосіб, описаний вище, де зазначена рослина або зазначений матеріал для розмноження рослини являють собою злакову рослину або матеріал для розмноження злакової рослини. У конкретному варіанті здійснення за даним винаходом зазначеною злаковою рослиною або зазначеним матеріалом для розмноження злакової

рослини є пшениця. Ще в одному варіанті здійснення за даним винаходом зазначеною даною рослиною або зазначеним злаковим матеріалом для розмноження рослини є ячмінь.

Ще в одному аспекті за даним винаходом пропонується спосіб отримання дифенокназолу, який є фунгіцидно ефективним, що характеризується при цьому зниженим фітотоксичним ефектом при застосуванні щодо рослини або матеріалу для розмноження, при цьому зазначений спосіб передбачає отримання дифенокназолу таким чином, що щонайменше 51 % за вагою отриманого дифенокназолу являє собою 2R, 4S ізомер, зображений у вигляді формули(Ib) вище.

Даний винахід додатково пропонує спосіб, описаний вище, де зазначений фітотоксичний ефект викликає пожовтіння та/або побуріння листя рослини. "Фітотоксичність" відома фахівцеві в даній галузі. Хлороз можна описати як "збліднення тканини рослини, що пов'язане з порушенням вироблення хлорофілу, до світло-зеленого, жовтого або білого, спостережуваного по всій площі листа, або у вигляді крапок, або у вигляді плям". Некроз можна описати як "загибель тканини рослини, спостережувана у вигляді коричневих ділянок на листі, часто у вигляді точок або плям."

Ще в одному аспекті за даним винаходом пропонується спосіб отримання дифенокназолу, який відрізняється тим, що щонайменше 51 % за вагою отриманого дифенокназолу являє собою 2R, 4S ізомер, зображений у вигляді формули(Ib) вище.

Ще в одному варіанті здійснення за даним винаходом пропонується спосіб отримання дифенокназолу відповідно до даного винаходу, як описано вище.

Ще в одному аспекті за даним винаходом пропонується спосіб отримання дифенокназолу, який відрізняється тим, що щонайменше 40 % за вагою отриманого дифенокназолу являє собою 2R, 4S ізомер, зображений у вигляді формули (Ib) вище, та де щонайменше 90 % за вагою решти отриманого дифенокназолу являє собою 2S, 4S ізомер, зображений у вигляді формули (Id) вище. У переважному варіанті здійснення за даним винаходом вся зазначена решта отриманого дифенокназолу являє собою 2S, 4S ізомер, зображений у вигляді формули (Id) вище.

Ще в одному варіанті здійснення за даним винаходом пропонується спосіб отримання дифенокназолу, при цьому зазначений спосіб передбачає отримання дифенокназолу, який містить кількості за вагою ізомерів, як описано вище відповідно до даного винаходу.

Дифенокназол доступний на ринку у вигляді суміші 4 ізомерів (Ia), (Ib), (Ic) та (Id). Розділення цих 4 ізомерів є можливим, наприклад, використовуючи високоефективну рідинну хроматографію з хіральною нерухомою фазою. Фахівцеві в даній галузі добре відомо, як здійснювати розділення стереоізомерів за допомогою стандартних методик, добре відомих з рівня техніки.

При більш ефективному підході фахівець у даній галузі може використовувати комерційно доступний чистий (2S)-пропан-1,2-діол і піддавати його реакції з 1-[2-хлор-4-(4-хлорфеноксі)феніл]етаном, дотримуючись методик синтезу, які аналогічні описаним у патенті США 5266585 (приклади 5a, 5b та 6). Отриману в результаті неочищену суміш, що складається, головним чином, із сполук Ib та Id, потім можна легко очистити та розділити за допомогою стандартної колонкової хроматографії на силікагелі. Суміші, охарактеризовані в даному описі, можуть бути отримані за допомогою даних очищених діастереоізомерів.

Ще в одному аспекті за даним винаходом пропонується застосування описаної вище композиції за даним винаходом у способі боротьби з грибами на рослині або її матеріалі для розмноження, де зазначена композиція характеризується зниженим фітотоксичним ефектом щодо зазначеної рослини.

Ще в одному варіанті здійснення за даним винаходом пропонується застосування, описане вище, де зазначена композиція містить щонайменше 60 % за вагою 2R, 4S ізомеру, зображеного у вигляді (Ib), та решта дифенокназолу являє собою 2S, 4S ізомер, зображений у вигляді формули (Id). Таким чином, така композиція містить, наприклад, 60 % за вагою 2R, 4S ізомеру, зображеного у вигляді (Ib), та 40 % за вагою 2S, 4S ізомеру, зображеного у вигляді формули(Id).

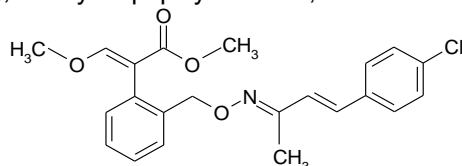
Ще в одному варіанті здійснення даного винаходу пропонується застосування, описане вище, де зазначена композиція містить щонайменше 80 % за вагою 2R, 4S ізомеру, зображеного у вигляді (Ib), та решта дифенокназолу являє собою 2S, 4S ізомер, зображений у вигляді формули (Id). Таким чином, така композиція містить, наприклад, 80 % за вагою 2R, 4S ізомеру, зображеного у вигляді (Ib) та 20 % за вагою 2S, 4S ізомеру, зображеного у вигляді формули (Id).

Всі представлені в даному описі способи і застосування охоплюють композицію за даним винаходом, описану вище, що містить дифенокназол.

При використанні будь-якої композиції відповідно до даного винаходу, що містить дифеноконазол, може також містити додаткові активні інгредієнти, наприклад, інсектицид, фунгіцид, нематодцид, синергіст, гербіцид, регулятор росту рослин або сполуки, що сприяє "життєстійкості рослини". Приклади активних інгредієнтів, які можуть бути додані до композиції, що містить дифеноконазол, включають всі сполуки, перераховані в The Pesticide Manual (British Crop Production Council – ISBN No. 9781901396188), доступному на www.bcpcc.org.

Дифеноконазол за даним винаходом застосовується в композиції окремо або в комбінації з наступними активними інгредієнтами, числа в дужках нижче, головним чином, відносяться до запису в тринадцятому виданні The Pesticide Manual:

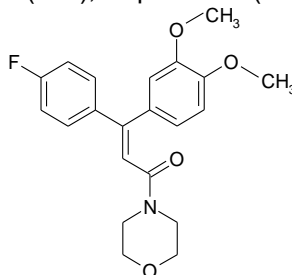
азоксистробін (47), димоксистробін (226), флуоксистробін (382), крезоксим-метил (485), метоміностробін (551), орикастробін, пікоксистробін (647), піраклостробін (690); трифлуксистробін (832), сполуки формули В-1.1,



(B-1.1)

азаконазол (40), бромуконазол (96), ципроконазол (207), диніконазол (267), диніконазол-М (267), епоксиконазол (298), фенбуконазол (329), флуквіконазол (385), флузілазол (393), флутріафол (397), гексаконазол (435), імазаліл (449), імібенконазол (457), іпконазол (468), метконазол (525), міклобутаніл (564), окспоконазол (607), пефуразоат (618), пенконазол (619), прохлораз (659), пропіконазол (675), протіконазол (685), симеконазол (731), тебуконазол (761), тетраконазол (778), тріадимефон (814), тріадименол (815), трифлумізол (834), трітіконазол (842), диклобутразол (1068), етаконазол (1129), фурконазол (1198), фурконазол-цис (1199) та квінконазол (1378);

алдиморф (реєстраційний номер CAS 91315-15-0), додеморф (288), фенпропіморф (344), тридеморф (830), фенпропідин (343), спіроксамін (740), піпералін (648), сполуки формули В-3.1,

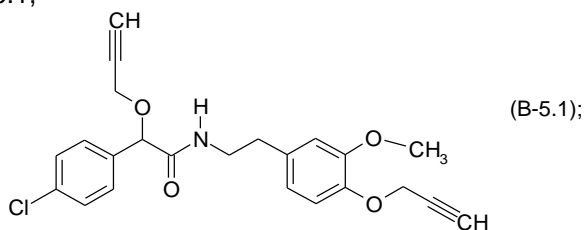


(B-3.1)

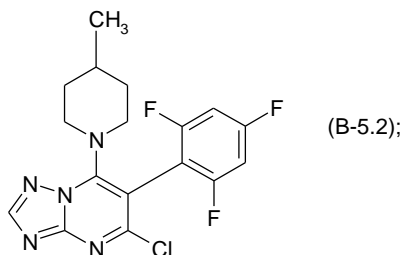
ципродиніл (208), мепаніпірим (508), піриметаніл (705), анілазин (878), беналаксил (56), беналаксил-М, беноданіл (896), беноміл (62), бентіавалікарб, бентіавалікарб-ізопропіл (68), біфеніл (81), бітертанол (84), бластицидин-S (85), бордоська суміш (87), боскалід (88), бупіримат (98), хлорид кадмію, каптафол (113), каптан (114), карбендазим (116), сірковуглець (945), карбоксин (120), карпропамід (122), масло з хвої кедра, хінометіонат (126), хлор, хлороніб (139), хлороталоніл (142), хлоролінат (149), коричний альдегід, мідь, карбонат міді-амонію, гідроксид міді (169), октаноат міді (170), олеат міді, сульфат міді (87), ціазофамід (185), циклогексимід (1022), цимоксаніл (200), дихлофлуанід (230), дихлон (1052), дихлорпропен (233), диклоцимет (237), дикломезин (239), диклоран (240), діетофенкарб (245), дифлуметорим (253), диметиримол (1082), диметоморф (263), динокап (270), дитіанон (279), додин (289), едифенфос (290), етабоксам (304), етирیمол (1133), етридіазол (321), фамоксадон (322), фенамідон (325), фенаміносульф (1144), фенаміфос (326), фенаримол (327), фенфурам (333), фенгексамід (334), феноксаніл (338), фенпиклоніл (341), фентин ацетат (347), фентин хлорид, фентин гідроксид (347), фербам (350), феримзон (351), флуазинам (363), флудіоксоніл (368), флусульфамід (394), флутоланіл (396), фолпет (400), формальдегід (404), фосетил-алюміній (407), фталід (643), фуберидазол (419), фуралаксил (410), фураметпір (411), флуодин (1205), фуазатин (422), гексахлорбензол (434), гімексазол, іміноктадин трис(албесилат) (реєстраційний номер CAS: 99257-43-9), йодокарб (3-йодо-2-пропінілбутилкарбамат), іпробенфос (IBP) (469), іпродіон (470), іпровалікарб (471), ізопротіолан (474), касугаміцин (483), манкозеб (496), манеб (497), диметилдитіокарбамат марганцю, мефеноксам (Металаксил-М) (517), мепроніл (510), хлорид ртуті (511), ртуть, металаксил (516), метасульфоккарб (528), метирам (546), метрафенон, набам (566), масло німу (гідрофобний екстракт), нуаримол (587), октабонон (590), офурас (592), оксаксидил (601), оксинова мідь (605), оксолінова кислота (606), оксикарбоксин (608), окситетрациклін (611), паклобутразол (612), парафінове масло (628), параформальдегід,

пенцикурон (620), пентахлорнітробензол (716), пентахлорфенол (623), пентіопірад, перфуразоат, фосфорна кислота, поліоксин (654), цинкова сіль поліоксину D (654), бікарбонат калію, пробеназол (658), процимідон (660), пропамокарб (668), пропінеб (676), проквіназид (682), протіокарб (1361), піразофос (693), пірифенокс (703), піроквілон (710), квіноксифен (715), квінтозен (PCN(B) (716), силтіофам (729), бікарбонат натрію, діацетат натрію, пропіонат натрію, стрептоміцин (744), сірка (754), TCMТВ, теклофталам, текназен (TCN(B) (767), тіабендазол (790), тифлузамід (796), тіофанат (1435), тіофанат-метил (802), тирам (804), толклофос-метил (808), толіфлуанід (810), тріазоксид (821), гриб *trichoderma harzianum* (825), трициклазол (828), трифорин (838), трифеніл-гідроксид олова (347), валідаміцин (846), вінклозолін (849), цинеб (855), цирам (856), зоксамід (857), 1,1-біс(4-хлорфеніл)-2-етоксіетанол (назва згідно з IUPAC) (910), 2,4-дихлорфенілбензолсульфонат (назва згідно з IUPAC/Хімічною реферативною службою) (1059), 2-фтор-N-метил-N-1-нафтилацетамід (назва згідно з IUPAC) (1295), 4-хлорфенілфенілсульфон (назвазгідно з IUPAC) (981),

сполука формули В-5.1,



сполука формули В-5.2,



сполука формули В-5.3,



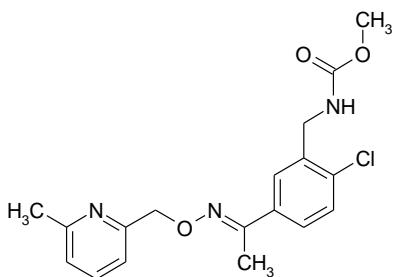
сполука формули В-5.4,



сполука формули В-5.5,

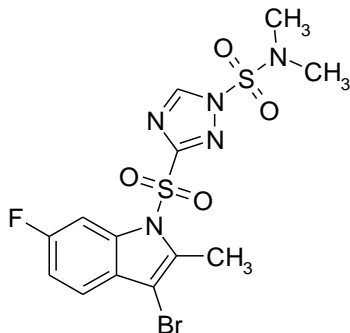


сполука формули В-5.6,



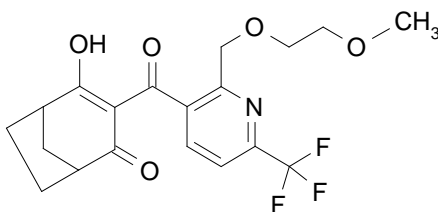
(B-5.6),

сполука формули B-5.7,



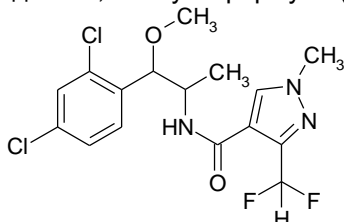
(B-5.7),

- 3-дифторметил-1-метил-1H-піразол-4-карбонової кислоти (2-біциклопропіл-2-іл-феніл)-амід (сполука B-5.8), 3-дифторметил-1-метил-1H-піразол-4-карбонової кислоти (9-ізопропіл-1,2,3,4-тетрагідро-1,4-метано-нафталін-5-іл)-амід (сполука B-5.9), 1,3-диметил-5-фтор-1H-піразол-4-карбонової кислоти [2-(1,3-диметилбутил)феніл]-амід (сполука B-5.10), 3-дифторметил-1-метил-1H-піразол-4-карбонової кислоти (3",4'-дихлор-5-фтор-1,1'-біфеніл-2-іл)-амід (сполука B-5.11, біксафен), N-2-{3-хлор-5-(трифторметил)піридин-2-іл}етил}-2-(трифторметил)бензамід (сполука B-5.12, флуопірам), 3-дифторметил-1-метил-1H-піразол-4-карбонової кислоти N-[2-(1,1,2,2-тетрафторетоксі)феніл]-амід (сполука B-5.13), 3-дифторметил-1-метил-1H-піразол-4-карбонової кислоти N-[2-(1,1,2,3,3,3-гексафторпропокси)феніл]-амід (сполука B-5.14), 3-дифторметил-1-метил-1H-піразол-4-карбонової кислоти N-[2-(2-хлор-1,1,2-трифторетокси)феніл]-амід (сполука B-5.15), 3-дифторметил-1-метил-1H-піразол-4-карбонової кислоти N-(4'-трифторметил-біфен-2-іл)-амід (сполука B-5.16), 3-дифторметил-1-метил-1H-піразол-4-карбонової кислоти N-(2'-трифторметил-біфен-2-іл)-амід (сполука B-5.17) та 3-дифторметил-1-метил-1H-піразол-4-карбонової кислоти N-(2'-трифторметил-біфен-2-іл)-амід (сполука B-5.18), ацибензолар-S-метил (6), хлормекват хлорид (137), етефон (307), мепікват хлорид (509) і тринексапак-етил (841); абамектин (1), клотіанідин (165), емаектин бензоат (291), імідаклоприд (458), тефлутрин (769), тіаметоксам (792), гліфосат (419), сполука формули V,



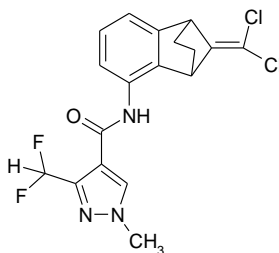
(V),

- 20 фомесафен, ізопіразам, седаксан, сполука формули (VI),



(VI),

сполука формули (VII),



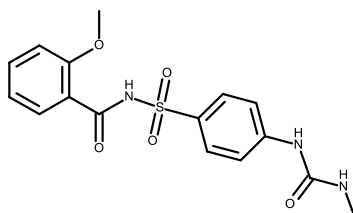
(VII),

1-[4-[4-[(5S)5-(2,6-дифторфеніл)-4,5-дигідро-1,2-оксазол-3-іл]-1,3-тіазол-2-іл]піперидин-1-іл]-2-[5-метил-3-(трифторметил)-1H-піразол-1-іл]етанон, 1-[4-[4-[5-(2,6-дифторфеніл)-4,5-дигідро-1,2-оксазол-3-іл]-1,3-тіазол-2-іл]піперидин-1-іл]-2-[5-метил-3-(трифторметил)-1H-піразол-1-іл]етанон, флуксапіроксад, фосфориста кислота, натрієва сіль фосфористої кислоти та амонійна сіль фосфористої кислоти.

Переважні суміші дифеноконазолу відповідно до даного винаходу (відносяться до тих же переліків, що і дифеноконазол) включають наступні: дифеноконазол і ципроконазол; дифеноконазол і пропіконазол; дифеноконазол і хлороталоніл; дифеноконазол і паклобутразол; дифеноконазол і ізопіразам; дифеноконазол і азоксистробін; дифеноконазол і азоксистробін і флудіоксоніл; дифеноконазол і флудіоксоніл; дифеноконазол і ципродиніл; дифеноконазол і ацибензолар-S-метил; дифеноконазол і піраклостробін; дифеноконазол і цифлуфенамід; дифеноконазол і фенпропідин; дифеноконазол і мефеноксам; дифеноконазол і тіаметоксам; дифеноконазол і метрафенон; дифеноконазол і тебуконазол; дифеноконазол і пенконазол; дифеноконазол і епоксиконазол; дифеноконазол і протіоконазол; дифеноконазол і мефеноксам; дифеноконазол та іпконазол; дифеноконазол і гексаконазол; дифеноконазол і абамектин; дифеноконазол і тринексапак; дифеноконазол і 1-метилциклопропен; дифеноконазол і трициклазол; дифеноконазол і лямбда-цигалотрин; дифеноконазол і S-метолахлор; дифеноконазол і мезотріон; дифеноконазол і одна зі сполук, згаданих у WO2010/063700; дифеноконазол і один з класу фунгіцидів інгібіторів сукцинатдегідрогенази (SDHI); дифеноконазол і беноданіл; дифеноконазол і флутоланіл; дифеноконазол і мепроніл; дифеноконазол і флуопірам; дифеноконазол і фенфурам; дифеноконазол і карбоксин оксикарбоксин; дифеноконазол і тифлузамід; дифеноконазол і біксафен; дифеноконазол і фураметпір; дифеноконазол і ізопіразам; дифеноконазол і пенфлуфен; дифеноконазол і пентіопірад; дифеноконазол і седаксан; дифеноконазол і флуксапіроксад і дифеноконазол і боскалід.

Ще більш переважні суміші відповідно до даного винаходу включають наступні: дифеноконазол і бензовіндифлупір (бензовіндифлупір являє собою 3-дифторметил-1-метил-1H-піразол-4-карбонової кислоти (9-дихлорметилден-1,2,3,4-тетрагідро-1,4-метан-нафтаден-5-іл)-амід, його мікробіоцидні властивості описані, наприклад, у WO 2007/048556); дифеноконазол і хлороталоніл; дифеноконазол і фолпет; дифеноконазол і пропіконазол; дифеноконазол і протіоконазол; дифеноконазол та ізопіразам; дифеноконазол і фенпропідин; дифеноконазол і пропіконазол і хлороталоніл; дифеноконазол і пропіконазол і фенпропідин; дифеноконазол і бензовіндифлупір і протіоконазол; дифеноконазол і пропіконазол і азоксистробін; дифеноконазол і пропіконазол і хлороталоніл; дифеноконазол і ципроконазол і пропіконазол; дифеноконазол і пропіконазол і фолпет; дифеноконазол і бензовіндифлупір і хлороталоніл; дифеноконазол і бензовіндифлупір і пропіконазол; дифеноконазол і бензовіндифлупір і азоксистробін; дифеноконазол і бензовіндифлупір і фенпропідин; дифеноконазол і бензовіндифлупір і фолпет; дифеноконазол і бензовіндифлупір і ципроконазол; дифеноконазол і бензовіндифлупір і боскалід; дифеноконазол і бензовіндифлупір і біксафен; дифеноконазол і бензовіндифлупір і пентіопірад; і дифеноконазол і бензовіндифлупір і флуксапіроксад. Особливо переважні суміші включають дифеноконазол і хлороталоніл, дифеноконазол і хлороталоніл і пропіконазол, дифеноконазол і метконазол, і дифеноконазол і бензовіндифлупір.

Відповідно до наступного аспекту за даним винаходом пропонується комбінація дифеноконазолу відповідно до даного винаходу із сполукою, вибраною з групи, що складається з наступних: клоквінтосет-мексил, абсцизова кислота та сполука формули II,



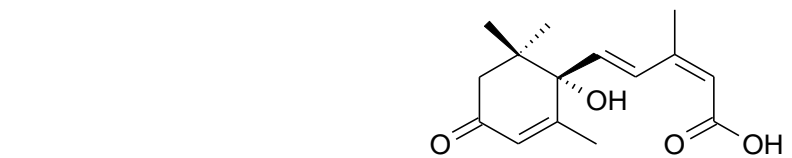
(II).

Клоквінтосет-мексил – (1-метилгексил [(5-хлор-8-хінолініл)оксі]ацетат) відомий як антидот гербіцидів і описаний у "The Pesticide Manual" [The Pesticide Manual-A World Compendium; Fourteenth Edition; Editor: C. D. S. Tomlin; The British Crop Protection Council] під реєстраційним номером 166. Хоча клоквінтосет-мексил є переважним, також є можливість застосування

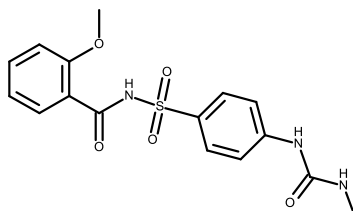
5

альтернативних солей і естерів клоквінтосету в комбінації з дифенокназолом відповідно до даного винаходу. Приклади солей і естерів клоквінтосету відомі фахівцям у даній галузі та серед іншого описані в патентній літературі EP94349, US4902340 та US5102445. Отже, відповідно до даного винаходу також передбачені клоквінтосет та його солі і естери, та їх можна використовувати для заміщення або доповнення клоквінтосет-мексилу.

10



Сполука формули II, а саме:



(II)

описані в патентній літературі WO2009/056333 і EP0365484. У попередньому посиланні сполука формули II описана як антидот для уберігання культур рису від фітотоксичної дії гербіцидів шляхом протруювання посівного матеріалу сполукою формули II.

15

Така комбінація, як описано вище, може використовуватися в будь-якому із способів, описаних у даному документі, і ці комбінації забезпечують синергічний ефект. Синергічний ефект має місце раз кожного разу, коли дія комбінації активних інгредієнтів більша, ніж сумарна дія окремих компонентів.

20

Розрахункова дія E для даної комбінації активних інгредієнтів підпорядковується так званій формулі Колбі та може бути розрахована наступним чином (COLBY, S.R. "Calculating synergistic and antagonistic responses of herbicide combination". Weeds, Vol. 15, pages 20-22; 1967):

ppm = міліграмів активного інгредієнта (= а.и.) на літр суміші для обприскування,

25

X = % дія активного інгредієнта A) при застосуванні p ppm активного інгредієнта,

Y = % дія активного інгредієнта B) при застосуванні q ppm активного інгредієнта.

Згідно COLBY розрахункова (адитивна) дія активних інгредієнтів (A)+(B) при застосуванні p+q ppm активного інгредієнта складає:

$$E = X + Y - \frac{X \cdot Y}{100}$$

30

Якщо фактично спостережувана дія (O) більше, ніж розрахункова дія (E), то дія комбінації є суперадитивною, тобто має місце синергічний ефект. Висловлюючись математично, показник синергізму SF відповідає O/E. В сільськогосподарській практиці $SF \geq 1,2$ вказує на значне поліпшення у порівнянні з абсолютно доповнюючим складанням активностей (очікувана активність), в той час як $SF \leq 0,9$ у повсякденному практичному застосуванні вказує на втрату активності порівняно з очікуваною активністю.

35

Проте, крім фактичної синергічної дії щодо фунгіцидної активності, композиції відповідно до даного винаходу також проявляють додаткові несподівані корисні властивості, які також можуть бути описані, в більш широкому сенсі, як синергічна активність. Прикладами таких корисних

властивостей, про які можна згадати, є наступні: розширення спектру фунгіцидної активності до інших фітопатогенів, наприклад, до стійких штамів; зниження норми внесення активних інгредієнтів; синергічна активність щодо шкідників тварин, наприклад, комах або представників класу кліщів; розширення спектру пестицидної активності щодо інших шкідників тварин, наприклад, стійких шкідників тварин; відповідний контроль шкідників за допомогою композицій відповідно до даного винаходу, навіть при нормі внесення, при якій окремі сполуки є абсолютно неефективними; переважні властивості протягом складання та/або при застосуванні, наприклад при помолі, просіюванні, емульгуванні, розчиненні або диспергуванні; підвищена стійкість при зберіганні; покращена стійкість до впливу світла; більш переважна здатність до розкладання; покращені токсикологічні та/або екотоксикологічні властивості; покращені характеристики корисних рослин, включаючи наступні: проростальність, урожайність культур, більш розвинена коренева система, збільшення пагоноутворення, збільшення висоти рослин, більша пластинка листа, менше в'янення базального листа, сильніші пагони, зеленіший колір листа, менш необхідна кількість добрив, менш необхідна кількість насіння, пагони з більшою урожайністю, більш раннє цвітіння, раннє дозрівання зерен, менше падіння рослин (вилягання), збільшений ріст проростків, підвищена потужність рослин і раннє проростання або будь-яка інша перевага, відома фахівцю у даній галузі.

Вагове співвідношення дифеноконазолу, що є компонентом А):компонента В) – що є сполукою, з якою відповідно до даного винаходу можна змішувати дифеноконазол, обрано таким чином, щоб забезпечувати синергічну активність. Як правило, вагове співвідношення А): В) складає в порядку зростання переваги від 2000:1 до 1:2000, від 1000:1 до 1:1000, від 500:1 до 1:500, від 100:1 до 1:100, від 50:1 до 1:50.

Відповідно до даного винаходу "рослина", як правило, включає наступні види рослин: виноградники; злакові, такі як пшениця, ячмінь, кукурудза, рис, жито або овес; буряк, наприклад, цукровий буряк або кормовий буряк; фрукти, наприклад, зерняткові, кісточкові або ягоди, наприклад, різновиди яблуні, різновиди груші, різновиди сливи, різновиди персика, різновиди мигдалю, різновиди вишні, різновиди полуниці, різновиди малини або різновиди ожини; бобові рослини, такі як боби, сочевиця, горох або соя; олійні рослини, такі як рапс, гірчиця, мак, різновиди оливков, соняшник, кокосовий горіх, різновиди рицини, какао-боби або земляні горіхи; огіркові рослини, такі як кабачки, огірки або дині; волокнисті рослини, такі як бавовна, льон, коноплі та джут, цитрусові, такі як апельсини, лимони, грейпфрут або мандарини; овочі, такі як шпинат, салат, спаржа, капуста, морква, цибуля, помідори, картопля, різновиди гарбуза і паприка; лаврові, такі як авокадо, кориця або камфора; маїс; тютюн; горіхи; кавове дерево; цукрова тростина; чай; в'юнкі рослини; хміль; дуріан; банани; каучоконосні рослини; дерен і декоративні рослини, такі як квіти, чагарники, листяні дерева і вічнозелені рослини, наприклад, хвойні дерева. Цей перелік не є таким, що будь-яким чином обмежує.

Злакові, зокрема, пшениця, рис, кукурудза та ячмінь, представляють особливий інтерес для даного винаходу, особливо, пшениця та ячмінь.

Терміни "рослина" та "рослини" також включають рослини, яким надали стійкість до гербіцидів, інсектицидів, фунгіцидів, або які модифікували будь-яким іншим способом, наприклад, з метою підвищення врожайності, засухостійкості або якості, за допомогою традиційних способів селекції або методик генної інженерії. Будь-які генетично модифіковані рослини, використовувані відповідно до даного винаходу, могли бути модифіковані шляхом використання технологій рекомбінантних нуклеїнових кислот, добре відомих фахівцю у даній галузі.

Вираз "місце зростання" має на увазі місце, на якому ростуть рослини, де висіяні матеріали для розмноження рослин або куди матеріали для розмноження рослини будуть поміщені для зростання, як, наприклад, середовище або ґрунт. Прикладом місця зростання є поле, на якому вирощують культурні рослини.

Вираз "матеріал для розмноження рослини" потрібно розуміти як генеративні частини рослини, такі як насіння, яке можна застосовувати для розмноження останніх, і вегетативний матеріал, такий як живці або бульби, наприклад, коріння, плоди, бульби, цибулини, кореневища і частини рослин. Пророслі рослини та молоді рослини, які необхідно пересадити після проростання або після появи сходів з ґрунту, також можна включити в це визначення. Ці молоді рослини можна захистити до пересадки за допомогою повної або часткової обробки шляхом занурення. Переважно "рослинний матеріал для розмноження" потрібно розуміти як такий, що означає насіння.

Вираз "що уберігає", "антидот" і "що був убережений" відносяться до зниженого фітотоксичного ефекту дифеноконазолу. Вираз "знижений фітотоксичний ефект" визначено вище.

Ще в одному аспекті даний винахід також пропонує композицію, що містить дифеноконазол, описану вище, для забезпечення ефектів підсилення отриманих культур рослин. На додаток до вже відомих для дифеноконазолу ефектів посилення культур можуть бути отримані додаткові ефекти посилення культур.

5 Вираз "посилення культур" означає покращення потужності рослин, покращення якості рослин, покращення витривалості до факторів стресу.

Відповідно до даного винаходу "поліпшення потужності" означає, що певні ознаки є покращеними якісно або кількісно у порівнянні з такою ж ознакою у контрольної рослини, яка була вирощена в таких же умовах без застосування способу за даним винаходом. Такі ознаки включають без обмеження раннє та/або покращене проростання, поліпшену схожість, 10 можливість використовувати меншу кількість насіння, збільшений ріст коренів, більш розвинену кореневу систему, підвищене утворення корневих бульбочок, збільшене зростання пагонів, збільшене кушіння, сильніші паростки, більш продуктивні паростки, підвищену або поліпшену густоту стояння рослин, менше падіння рослин (вилягання), збільшення та/або поліпшення висоти рослин, збільшення ваги рослин (свіжої або сухої), великі листові пластинки, зеленіший 15 колір листа, підвищений вміст пігментів, підвищену фотосинтетичну активність, більш раннє цвітіння, довші волоті, раннє дозрівання зерна, збільшений розмір насіння, плодів або стручків, збільшена кількість стручків або класів, збільшена кількість насіння на стручок або колос, збільшену вагу насіння, збільшений налив насіння, меншу кількість опалих нижніх листків, затримку старіння, поліпшену життєздатність рослини, збільшені рівні амінокислот у тканинах, 20 що запасують, та/або меншу кількість необхідних ресурсів (наприклад, менша кількість необхідного добрива, води та/або трудових витрат). Рослина з покращеною потужністю може характеризуватися покращенням будь-якої з вищезазначених ознак, або будь-якої комбінації, або двох або більше з вищезазначених ознак.

Відповідно до даного винаходу "покращення якості рослин" означає, що певні ознаки є покращеними якісно або кількісно у порівнянні з такою ж ознакою у контрольної рослини, яку було вирощено в таких же умовах без застосування способу за даним винаходом. Такі ж ознаки включають без обмеження покращений зовнішній вигляд рослини, знижений етилен (знижене 25 продукування та/або інгібування рецепції), покращену якість зібраного матеріалу, наприклад, насіння, плодів, листя, овочів (така покращена якість може виражатися у вигляді покращеного зовнішнього вигляду зібраного матеріалу), покращений вміст вуглеводів (наприклад, збільшена кількість цукру та/або крохмалю, покращений цукрокислотний коефіцієнт, зниження відновлюючих цукрів, збільшена швидкість утворення цукру), покращений вміст білка, покращений вміст і композиція масла, покращену поживну цінність, зниження нехарчових 30 сполук, покращені органолептичні властивості (наприклад, покращений смак) та/або покращену корисність для здоров'я споживача (наприклад, збільшені рівні вітамінів і антиоксидантів), покращені післязбиральні характеристики (наприклад, збільшений термін зберігання та/або стійкість при зберіганні, здатність легше піддаватися переробці, простіша екстракція сполук) та/або покращену якість насіння (наприклад, для застосування в наступних сезонах). Рослина з 40 покращеною якістю може характеризуватися покращенням будь-якої з вищезазначених ознак, або будь-якої комбінації, або двох або більше з вищезазначених ознак.

Відповідно до даного винаходу "покращена витривалість до стресових факторів" означає, що певні ознаки є покращеними якісно або кількісно порівняно з такою ж ознакою у контрольної рослини, яка була вирощена в таких же умовах без застосування способу за даним винаходом. Такі ознаки включають необмежену підвищену витривалість та/або стійкість до абіотичних 45 стресових факторів, які викликають субоптимальні умови росту, таких як засуха (наприклад, будь-який стрес, який призводить до недостатнього вмісту води в рослинах, недостатньої здатності поглинати воду або до зниження забезпечення рослин водою), вплив холоду, вплив тепла, осмотичний стрес, УФ-стрес, затоплення, підвищена засоленість (наприклад, у ґрунті), збільшений вплив мінералів, вплив озону, вплив сильного освітлення та/або обмежена 50 доступність поживних речовин (наприклад, поживних речовин азоту та або фосфору). Рослина з покращеною витривалістю до стресових факторів може характеризуватися покращенням будь-якою з вищезазначених ознак, або будь-якою комбінацією, або двох або більше з вищезазначених ознак. У випадку засухи та стресу, викликаного недовіком поживних речовин, такі покращені показники витривалості можуть бути обумовлені, наприклад, більш ефективним поглинанням, використанням або утриманням води та поживних речовин. 55

Будь-яке з підсилень культури або всі з перерахованих вище можуть призвести до покращеної врожайності за рахунок покращення, наприклад, фізіології рослин, росту та розвитку рослин та/або будови рослин. У контексті даного винаходу "урожай" включає без 60 обмеження (і) збільшення продукування біомаси, врожаю зерна, вмісту крохмалю, вмісту масла

та/або вмісту білка, що може бути результатом (а) збільшення кількості, що продукується самою по собі рослиною, або (b) покращення здатності до збирання рослинного матеріалу, (ii) покращення складу зібраного матеріалу (наприклад, покращені сахарокислотні коефіцієнти, покращений склад масла, підвищена поживна цінність, зменшена кількість неживих сполук, збільшена користь для здоров'я споживача) та/або (iii) збільшена/полегшена можливість збирання культури, покращена засвоюваність культури та/або краща стабільність при зберіганні/терміні зберігання. Збільшений урожай сільськогосподарської рослини означає, що там, де можливо виконати кількісне вимірювання, урожай продукту відповідної рослини збільшений на вимірювану кількість порівняно з урожаєм такого ж продукту рослини, отриманого в таких же умовах, але без застосування даного винаходу. Відповідно до даного винаходу переважно, щоб урожай збільшувався щонайменше на 0,5 %, більш переважно щонайменше на 1 %, ще більш переважно щонайменше на 2 % і ще більш переважно щонайменше на 4 %, переважно на 5 % або навіть більше.

Будь-яке або всі з перерахованих вище покращень якості культури можуть також призвести до більш раціонального використання землі, тобто земля, яка раніше була недоступною або субоптимальною щодо обробки, може стати доступною. Наприклад, рослини, які показують підвищену здатність до виживання в умовах засухи, можна культивувати в районах із субоптимальною кількістю атмосферних опадів, наприклад, скажімо, що межують з пустелею або навіть в самій пустелі.

При застосуванні щодо рослини відповідно до використання/способу за даним винаходом, дифенокназол (a.i.) зазвичай вносять при нормах внесення від 5 до 2000 г a.i./га, зокрема від 10 до 1000 г a.i./га, наприклад 50, 75, 100 або 200 г a.i./га, від 0,5 до 1000 г/га, переважно від 1 до 750 г/га, більш переважно від 2,5 до 500 г/га, більш переважно від 5 до 300 г/га, більш переважно від 7,5 до 200 г/га a.i. (активного інгредієнту). У переважному варіанті здійснення дифенокназол за даним винаходом застосовують щодо культур при нормі внесення аж до приблизно 130 г a.i./га, переважно аж до приблизно 125 г a.i./га.

У сільськогосподарській практиці норми внесення композицій згідно використанню/способу даного винаходу залежать від типу необхідного ефекту і, як правило, варіюють у діапазоні від 20 до 4000 г всієї композиції на гектар.

При використанні дифенокназолу для обробки насіння норми внесення від 0,001 до 50 г дифенокназолу на кг насіння, переважно від 0,01 до 10 г на кг насіння, зазвичай є достатніми.

Композицію, що містить дифенокназол відповідно до даного винаходу та будь-які суміші з іншими сполуками, як описано вище, можна застосовувати як склад в будь-якій звичайній формі, наприклад, у формі здвоєної упаковки, порошку для сухої обробки насіння (DS), емульсії для обробки насіння (ES), текучого концентрату для обробки насіння (FS), розчину для обробки насіння (LS), диспергованого у воді порошку для обробки насіння (WS), суспензії капсул для обробки насіння (CF), гелю для обробки насіння (GF), концентрату емульсії (EC), концентрату суспензії (SC), суспензії емульсії (SE), капсульної суспензії (CS), диспергованих у воді гранул (WG), емульгованих гранул (EG), емульсії типу вода в маслі (EO), емульсії типу масло в воді (EW), мікроемульсії (ME), масляної дисперсії (OD), змішаного з маслом текучого концентрату (OF), змішаної з маслом рідини (OL), розчинного концентрату (SL), суспензії для ультрамалооб'ємного внесення (SU), рідини для ультрамалооб'ємного внесення (UL), технічного концентрату (TK), диспергованого концентрату (DC), змочуваного порошка (WP) або будь-якого технічно можливого складу в комбінації з прийнятними в сільському господарстві допоміжними засобами.

Такі суміші і композиції можна отримати добре відомим фахівцю у даній галузі способом, наприклад, шляхом змішування активних інгредієнтів із щонайменше одним відповідним інертним допоміжним засобом для складання (наприклад, розріджувачами, розчинниками, наповнювачами і необов'язково іншими інгредієнтами для складання, такими як поверхнево-активні речовини, біоциди, антифризи, клейкі речовини, загусники і сполуки, які надають додаткові ефекти. Фахівцю в даній галузі необхідно з обережністю вибирати неактивні інгредієнти, особливо біоциди, таким чином, щоб вони не інгібували або не завдавали шкоди азотофіксуючим бактеріям). Якщо необхідна тривала дія, то можна застосовувати також склади з уповільненим вивільненням. Зокрема, склади для застосування в розпорошених станах, такі, як дисперговані у воді концентрати (наприклад, EC, SC, DC, OD, SE, EW, EO тощо), змочувані порошки та гранули, можуть містити поверхнево-активні речовини, такі як змочувані та дисперговані засоби та інші сполуки, які забезпечують допоміжний вплив, наприклад, продукт конденсації формальдегіду з нафталінсульфонатом, алкіларилсульфонат, лігнінсульфонат, алкілсульфат жирної кислоти та етоксильований алкілфенол, та етоксильований жирний спирт.

Інгредієнти для складання, добре відомі фахівцю у даній галузі, можуть, наприклад, включати такі складові інгредієнти, які не мають будь-якою значущою біологічною активністю, або зовсім не мають біологічної активності. Вони включають, наприклад, розріджувачі, розчинники, наповнювачі, поверхнево-активні речовини, біоциди, антифризи, речовини, що сприяють прилипанню, загусники та речовини, що забезпечують допоміжну дію.

Склад для протруювання насіння застосовують способом, відомим фахівцю у даній галузі, наприклад, у вигляді водної суспензії або сухого порошка, що характеризуються хорошим прилипанням до насіння. З рівня техніки відомі такі склади для протруювання насіння. Склади для протруювання насіння можуть містити окремі активні інгредієнти або комбінацію активних інгредієнтів в інкапсульованій формі, наприклад, у вигляді капсул або мікрокапсул повільного вивільнення. Типовий склад бакової суміші для застосування при обробці насіння містить від 0,25 до 80 %, зокрема від 1 до 75 %, необхідних інгредієнтів, та від 99,75 до 20 %, зокрема від 99 до 25 %, твердих або рідких допоміжних речовин (включаючи, наприклад, розчинник, такий як вода), де допоміжні речовини можуть бути поверхнево-активною речовиною в кількості від 0 до 40 %, зокрема від 0,5 до 30 %, в розрахунку на склад бакової суміші. Типовий склад готової суміші для застосування при обробці насіння містить від 0,5 до 99,9 %, зокрема від 1 до 95 %, необхідних інгредієнтів, та від 99,5 до 0,1 %, зокрема від 99 до 5 %, твердого або рідкого допоміжного засобу (включаючи, наприклад, розчинник, такий як вода), де допоміжні речовини можуть бути поверхнево-активною речовиною у кількості від 0 до 50 %, зокрема від 0,5 до 40 %, у розрахунку на склад готової суміші.

Як правило, склади включають від 0,01 до 90 % за вагою активного засобу, від 0 % до 20 % прийнятної в сільському господарстві поверхнево-активної речовини та від 10 до 99,99 % твердих або рідких інертних речовин і допоміжної(допоміжних) речовини(речовин), при цьому активний засіб складається із щонайменше дифеноконазолу, як описано вище, та необов'язково інших активних засобів, включаючи згадані вище та/або мікробіциди або консерванти, або подібні. Концентровані форми композицій, як правило, містять приблизно від 2 до 80 %, переважно приблизно від 5 % до 70 % за вагою активного засобу. Застосовувані форми складу можуть, наприклад, містити від 0,01 до 20 % за вагою, переважно від 0,01 до 5 % за вагою активного засобу. Оскільки комерційні продукти переважно будуть складені у вигляді концентратів, кінцевий споживач буде зазвичай використовувати розбавлені склади.

Наступні приклади служать для ілюстрації даного винаходу. Даний винахід не обмежується цими прикладами.

У цих прикладах використовували такі продукти.

Важкий ароматичний розчинник являє собою Solvesso 200, доступний від ExxonMobile, Кельн, Німеччина. Додецилбензолсульфонат кальцію являє собою Nansa EVM 62/H, доступний від Huntsman Surface Sciences, Кастільоне-делле-Стів'єре, Італія. 36-етоксилат рицинової олії являє собою Emulsogen EL360, доступний від Clariant, Франкфурт, Німеччина. 10-олеїлетоксилат являє собою Genapol O-100, доступний від Clariant, Франкфурт, Німеччина. Score 250ECTTM являє собою склад емульгованого концентрату, що містить 250 г/л дифеноконазолу, та є комерційно доступним від Syngenta, Дільсдорф, Швейцарія. Score 250ECTTM містить зазначені ізомери дифеноконазолу в наступному приблизному співвідношенні за вагою: 2S, 4R (Ia) – 30 %; 2R, 4S (Ib) – 30 %; 2R, 4R (Ic) 20 %; и 2S, 4S (Id) – 20 %.

Приклад 1

У 2 л трьохгорлій круглодонній колбі, обладнаній віддільником води, нагрівали 1-[2-хлор-4-(4-хлорфенокси)феніл]етанон (288,3 г), (2S)-пропан-1,2-діол (170,8 г) і п-толуолсульфонову кислоту (3,3 г) в толуолі із зворотнім холодильником. Після завершення реакції розчинник і надлишок пропандіолу видаляли під вакуумом.

Неочищену суміш ((Ib) 2R, 4S)- і ((Id) 2S, 4S)-метилдіоксолану потім перетворювали в кінцевий продукт, дотримуючись методик, описаних у прикладах 5b і 6 в патенті США № 5266585. Після екстрагування води розчинник випарювали у вакуумі. Отриманий неочищений продукт, що містить (Ib) і (Id) у співвідношенні приблизно 3:2, а також в'язке масло, очищали згідно з прикладом 2.

Приклад 2

100 г неочищеного продукту, отриманого в прикладі 1, розчиняли в 2-метокси-2-метилпропані (100 г) та очищали за допомогою колонкової хроматографії з використанням силікагелю як нерухомої фази та 2-метокси-2-метилпропану як елюенту. Цей спосіб забезпечував приблизно 20 г (Ib 2R, 4S) (цис-продукту) та приблизно 9 г (Id 2S, 4S) (транс-продукту), обидва з діастереоізомерною чистотою >98 %.

((Ib) 2R, 4S)

¹H ЯМР (300 МГц, CDCl₃): δ = 1,09 (d, J=6,1 Гц, 3 H), 3,07 (t, J=7,5 Гц, 1 H), 3,9 (dd, J=7,5 Гц, 1 H), 4,07 (dm, J=7,4, 6,1 Гц, 1 H), 4,75 (m, 2 H), 6,8 (dd, J=8,7, 2,5 Гц, 1 H), 6,95 (m, 2 H), 7,0 (d, J=2,5 Гц, 1 H), 7,31 (m, 2 H), 7,54 (d, J=8,7 Гц, 1 H), 7,91 (s, 1 H), 8,24 (s, 1 H).

((Id) 2S, 4S)

5 ¹H ЯМР (300 МГц, CDCl₃): δ = 1,10 (d, J=6,1 Гц, 3 H), 3,24 (t, J=8,2 Гц, 1 H), 3,77 (dm, J=8,2, 6,1 Гц, 1 H), 3,93 (dd, J=6,1, 8,2 Гц, 1 H), 4,67 (m, 2 H), 6,76 (dd, J=8,7, 2,5 Гц, 1 H), 6,92 (m, 2 H), 6,97 (d, J=2,5 Гц, 1 H), 7,26 (m, 2 H), 7,55 (d, J=8,7 Гц, 1 H), 7,83 (s, 1 H), 8,12 (s, 1 H).

Приклад 3

10 Даний приклад показує, що 2R, 4S стереоізомер дифеноконазолу (Ib) викликає менше фітотоксичне ушкодження пшениці, ніж стереоізмери 2S, 4R (Ia), 2R, 4R (Ic) та 2S, 4S (Id).

Склади емульгованого концентрату дифеноконазолу отримували із вмістом кожного з чотирьох можливих стереоізомерів окремо. Наступні композиції окремо завантажували в резервуари з мішалками та нагрівали до 80 °C протягом 1 години з отриманням прозорих жовтих рідин.

15

Приклад (у частинах за вагою)	3A	3B	3C	3D
Дифеконазол	2S, 4R (Ia) 23,7	2R, 4S (Ib) 23,7	2R, 4R (Ic) 23,7	2S, 4S (Id) 23,7
Додецилбензолсульфонат кальцію	4,6	4,6	4,6	4,6
36-етоксилат рицинової олії	6,5	6,5	6,5	6,5
10-олеїлетоксилат	3,7	3,7	3,7	3,7
Важкий ароматичний розчинник	61,3	61,3	61,3	61,3

Насіння пшениці (сорт "Riband") висівали в горщики діаметром 6,5 см при, як правило, 6 насінин на горщик. Середовище для вирощування містило 66,5 % торф'яного ґрунту TKS1, 30 % ґрунту для цукрових буряків та 3,5 % піску. Насіння покривали тонким шаром ґрунту та горщики поливали. Протягом дня висівання горщики обробляли 5 мл розчину регулятора росту тринексапак-етилу (Moddus 250 EC™ від Syngenta), 1 частину якого розчиняли в 1000 частинах води. Горщики зберігали в кімнаті з контрольованим навколишнім середовищем при постійній температурі 19 °C, відносній вологості 60 % та тривалості дня 14 годин до тестової обробки, під час якої вік рослин становив приблизно 3 тижні. Перед проведенням тестових обробок щільність рослин знижували до, як правило, 4 рослин на горщик.

25 Суміші на основі дифеноконазолу змішували з водою і розмішували за допомогою ультразвуку для отримання гомогенної емульсії. Потім готували розчини для обприскування при відношенні 9 частин води до 1 частини ізопропанолу за об'ємом. Тестові обробки проводили з використанням машини для обприскування з одним наконечником плоскоструменевої форсунки при висоті 60 см і калібрували для застосування, еквівалентного 200 літрам на гектар.

30 Симптоми фітотоксичності щодо пшениці, викликані дифеноконазолом, включали хлороз та/або некроз. Фітотоксичність оцінювали як відносне ушкодження рослини через 14 днів після нанесення, і результати наведені в наступній таблиці.

Приклад	Дифеконазол	125 г/га	250 г/га	500 г/га
3A	2S, 4R (Ia)	25	40	50
3B	2R, 4S (Ib)	2,5	1,0	3,5
3C	2R, 4R (Ic)	7,5	50	60
3D	2S, 4S (Id)	5	25	55

35

Приклад 4

Даний приклад показує, що ступінь фітотоксичного ушкодження пшениці залежить від співвідношення 2R, 4S дифеноконазолу (Ib) та 2S, 4S дифеноконазолу (Id).

40 Склади на основі емульгованого концентрату дифеноконазолу готували із вмістом 2R, 4S дифеноконазолу (Ib) та 2S, 4S дифеноконазолу (Id) у різних співвідношеннях. Наступні композиції окремо завантажували в резервуари з мішалками та нагрівали до 80 °C протягом 1 години з отриманням прозорих жовтих рідин.

Приклад (в частинах за вагою)	4A	4B	4C	4D	4E	4F
Дифеноконазол 2R, 4S (Ib)	9,5 (40 %)	11,8 (50 %)	14,2 (60 %)	16,6 (70 %)	19,0 (80 %)	21,3 (90 %)
Дифеноконазол 2S, 4S (Id)	14,2 (60 %)	11,8 (50 %)	9,5 (40 %)	7,1 (30 %)	4,7 (20 %)	2,4 (10 %)
Додецилбензолсульфонат кальцію	4,6	4,6	4,6	4,6	4,6	4,6
36-етоксилат рицинової олії	6,5	6,5	6,5	6,5	6,5	6,5
10-олеїлетоксилат	3,7	3,7	3,7	3,7	3,7	3,7
Важкий ароматичний розчинник	61,3	61,3	61,3	61,3	61,3	61,3

- 5 Вирощували тестові рослини пшениці і склади застосовували як в прикладі 3. Експериментальні склади, що містять 2R, 4S дифеноконазол (Ib) та 2S, 4S дифеноконазол (Id), тестували разом з комерційним продуктом, Score 250EC™, який містить всі чотири стереоізомера (Ia, Ib, Ic і Id). Ознаки фітотоксичності у пшениці, викликані дифеноконазолом, включали хлороз та/або некроз. Фітотоксичність оцінювали як відсоток ушкодження рослин через 14 днів після нанесення, і результати наведені в наступній таблиці.

Приклад	100 г/га	200 г/га	400 г/га
4A	0,5	8,0	20
4B	1,0	2,8	20
4C	0,0	1,0	7,5
4D	0,0	1,0	10
4E	0,5	1,0	4,3
4F	0,0	0,0	5,5
Score 250EC™ розглянутий вище	15	30	45

10

Приклад 5

Даний приклад додатково показує, що ступінь фітотоксичного ушкодження пшениці залежить від співвідношення 2R, 4S дифеноконазолу (Ib) та 2S, 4S дифеноконазолу.

- 15 Вирощували тестові рослини пшениці та склади застосовували як у прикладі 3. Експериментальні склади, що містять 2R, 4S дифеноконазол (Ib) та 2S, 4S дифеноконазол (Id), тестували разом з комерційним продуктом, Score 250EC™, який містить всі чотири стереоізомера (Ia, Ib, Ic і Id). Ознаки фітотоксичності у пшениці, викликані дифеноконазолом, включали хлороз та/або некроз. Фітотоксичність оцінювали як відсоток ушкодження рослин через 14 днів після нанесення, і результати наведені в наступній таблиці.

20

Приклад	100 г/га	200 г/га	400 г/га
3B (100 % Ib)	0	2	4
4F (90 % Ib, 10 % Id)	0	0	5
4E (80 % Ib, 20 % Id)	0	1	5
4C (60 % Ib, 40 % Id)	2	4	7
3D (100 % Id)	2,5	15	40
Score 250EC™ розглянутий вище	5	13,5	40

Приклад 6

- 25 Даний приклад показує, що ступінь фітотоксичного ушкодження вирощеної на полі пшениці, викликаного складом з підвищеним вмістом 2R, 4S дифеноконазолу, є зниженим у порівнянні зі стандартним продуктом, і що біологічна дія є еквівалентною.

- 30 Склад на основі емульгованого концентрату з прикладу 4C, що містить 60 % 2R, 4S дифеноконазолу (Ib) та 40 % 2S, 4S дифеноконазолу (Id), застосовували щодо пшениці в 11 окремих польових випробуваннях у 4 різних країнах Північної Європи разом з комерційним продуктом, Score 250EC™, який містить всі чотири стереоізомера (Ia, Ib, Ic і Id) в описаних вище співвідношеннях. Продукти застосовували двічі в еквіваленті 200 літрів води на гектар на стадії росту BBCH 32 і 39. Фітотоксичність спостерігали у 8 випробуваннях, від 7 до 10 днів після першого застосування та оцінювали як % ушкодження листа. Зараження *Septoria tritici*

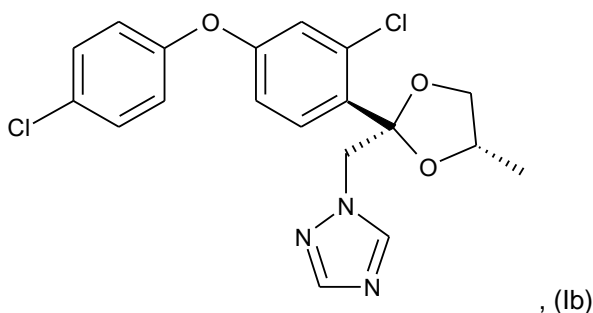
спостерігали у 5 випробуваннях від стадії росту 39 та оцінювали на покривному листі, листі номер 2 та листі номер 3, як відсоток зараження.

Приклад	4C	Score 250EC™
Фітотоксичність при 250 г/га (a)	8	14,5
Фітотоксичність при 125 г/га (a)	3	8
Контроль <i>S. tritici</i> при 125 г/га (b)	7	4

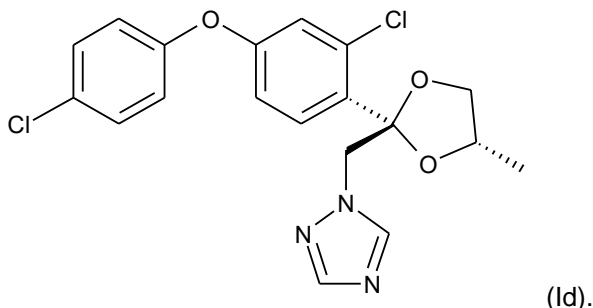
- 5 (a) Середнє значення % ушкодження листа з 8 випробувань
(b) Середнє значення % зараження з 5 випробувань.

ФОРМУЛА ВИНАХОДУ

- 10 1. Фунгіцидна композиція, що містить дифеноконазол, яка **відрізняється** тим, що щонайменше 40 % за вагою зазначеного дифеноконазолу являє собою 2R,4S-ізомер, зображений у вигляді формули (Ib):



- 15 та де щонайменше 95 % за вагою решти дифеноконазолу являє собою 2S,4S-ізомер, зображений у вигляді формули (Id):



- 20 2. Фунгіцидна композиція за п. 1, де вся зазначена решта дифеноконазолу являє собою зазначений 2S,4S-ізомер, зображений у вигляді формули (Id).
3. Фунгіцидна композиція за п. 1 або п. 2, де щонайменше 55 % за вагою зазначеного дифеноконазолу являє собою 2R,4S-ізомер, зображений у вигляді формули (Ib).
- 25 4. Фунгіцидна композиція за п. 1 або п. 2, де щонайменше 60 % за вагою зазначеного дифеноконазолу являє собою 2R,4S-ізомер, зображений у вигляді формули (Ib).
5. Фунгіцидна композиція за п. 1 або п. 2, де щонайменше 65 % за вагою зазначеного дифеноконазолу являє собою 2R,4S-ізомер, зображений у вигляді формули (Ib).
6. Фунгіцидна композиція за п. 1 або п. 2, де щонайменше 80 % за вагою зазначеного дифеноконазолу являє собою 2R,4S-ізомер, зображений у вигляді формули (Ib).
- 30 7. Фунгіцидна композиція за будь-яким з пп. 1-6, що додатково містить один або декілька компонентів, вибраних з групи, яка складається з допоміжного засобу, носія і поверхнево-активної речовини.
8. Рослина або матеріал для розмноження, що містять композицію за будь-яким з пп. 1-7
- 35 внаслідок обробки.
9. Рослина або матеріал для розмноження за п. 8, які являють собою злакову рослину або матеріал для розмноження злакових.
10. Рослина або матеріал для розмноження за п. 9, які являють собою пшеницю або ячмінь.

11. Спосіб контролю грибів на рослині або матеріалі для розмноження, який передбачає застосування до вказаної рослини або матеріалу для розмноження фунгіцидно ефективної кількості композиції за будь-яким з пп. 1-7.

5 12. Спосіб захисту рослини або матеріалу для розмноження рослини від фітотоксичного ефекту композиції, що містить дифеноконазол, при цьому зазначений спосіб полягає в тому, що на зазначену рослину або матеріал для розмноження рослини наносять фунгіцидну композицію за будь-яким з пп. 1-7.

13. Спосіб за п. 12, де зазначена рослина або матеріал для розмноження рослини являють собою пшеницю або ячмінь.

10

Комп'ютерна верстка І. Мироненко

Міністерство економічного розвитку і торгівлі України, вул. М. Грушевського, 12/2, м. Київ, 01008, Україна

ДП "Український інститут інтелектуальної власності", вул. Глазунова, 1, м. Київ – 42, 01601